

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2005 年 9 月 1 日 (01.09.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/080411 A1

(51) 国際特許分類: C07H 21/04, C07F  
9/6558, 9/6561, C12N 15/11

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/002058

(22) 国際出願日: 2005 年 2 月 10 日 (10.02.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2004-049312 2004 年 2 月 25 日 (25.02.2004) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 独立  
行政法人科学技術振興機構 (JAPAN SCIENCE AND  
TECHNOLOGY AGENCY) [JP/JP]; 〒3320012 埼玉県  
川口市本町四丁目 1 番 8 号 Saitama (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 関根 光雄  
(SEKINE, Mitsuo) [JP/JP]; 〒2250011 神奈川県横浜  
市青葉区あざみ野 1-26-46 Kanagawa (JP). 清尾  
康志 (SEIO, Kohji) [JP/JP]; 〒2270054 神奈川県青葉  
区しらとり台 4-8-5 第2パークサイド内田 102  
Kanagawa (JP). 大窪 章寛 (OHKUBO, Akihiro) [JP/JP];  
〒1940003 東京都町田市小川 1-10-5-202  
Tokyo (JP).

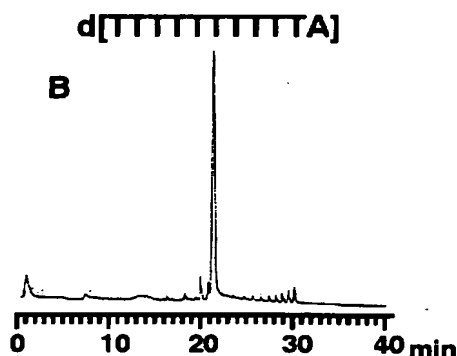
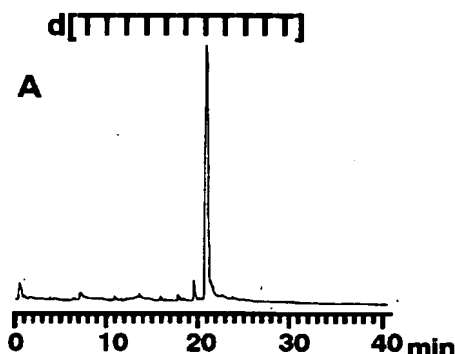
(74) 代理人: 阿部 正博 (ABE, Masahiro); 〒2740825 千葉  
県船橋市前原西二丁目 14 番 1 号ダイアパレス津田  
沼 1001 号 Chiba (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が  
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,  
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,  
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,

[続葉有]

(54) Title: 3' -TERMINAL NUCLEOSIDE UNIT CONTAINING PHOSPHORAMIDITE

(54) 発明の名称: ホスホロアミダイトを含む 3' 末端ヌクレオシドユニット



(57) Abstract: It is intended to provide a method of binding a 3' -terminal nucleoside to a hydroxyl group on a solid phase under the same conditions as in a DNA chain extension reaction. A 3' -terminal nucleoside unit containing phosphoramidite which is a compound represented by the following general formula (I): (N)-O-(R1)Si(R2)-(C6H4)-(CH2)n-O-P(OR3)N(R4)(R5) wherein (N) stands for an arbitrary nucleoside or its derivative; R1, R2, R4 and R5 are each an alkyl group or an aryl group; R3 is a phosphate-protecting group; and n is an integer of from 1 to 5; a solid phase support having a 3' -terminal nucleoside unit, which is the above compound, transferred thereto; and a method of synthesizing a nucleic acid oligomer with the use of this solid phase support.

(57) 要約: 本発明の目的は、DNAの鎖長伸長反応と全く同一の条件で、任意の塩基を含む 3' 末端ヌクレオシドを固相上の水酸基に結合する方法を提供することである。本発明は、以下の一般式 (I) で示される化合物である、ホスホロアミダイトを含む 3' 末端ヌクレオシドユニット: (N)-O-(R1)Si(R2)-(C6H4)-(CH2)n-O-P(OR3)N(R4)(R5) (I) (式中、(N) は任意のヌクレオシド又はその誘導体であり、R1、R2、R4 及び R5 はアルキル基又はアリール基であり、R3 はリン酸基の保護基であり、n は 1~5 の整数である)、該化合物である 3' 末端ヌクレオシドユニットが導入されている固相担体、及び、該固相担体を用いる、核酸オリゴマーの合成方法に係る。

WO 2005/080411 A1



LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI,  
NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG,  
SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,  
VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),  
OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,  
MR, NE, SN, TD, TG).

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護  
が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA,  
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ,  
BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE,  
BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,

添付公開書類:

— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。